

Bibliographic Information

Preparation of alkoxy-pyridylpyrimidines as agrochemical fungicides. Vermehren, Jan; Giencke, Wolfgang; Braun, Peter; Sachse, Burkhard. (Hoechst A.-G., Germany). Ger. Offen. (1992), 24 pp. CODEN: GWXXBX DE 4029649 A1 19920326 Patent written in German. Application: DE 90-4029649 19900919. Priority: . CAN 117:48595 AN 1992:448595 CAPLUS (Copyright (C) 2006 ACS on SciFinder (R))

Patent Family Information

<u>Patent No.</u>	<u>Kind</u>	<u>Date</u>	<u>Application No.</u>	<u>Date</u>
DE 4029649	A1	19920326	DE 1990-4029649	19900919

Priority Application

DE 1990-4029649	19900919
-----------------	----------

Abstract

Title compds. I [R1 = H, C2-6 alkyl, substituted C1-4 alkyl, C2-6 alkenyl, C2-6 alkynyl, C3-7 cycloalkyl, (substituted) Ph, etc.; R2,R4 = H, C1-6 alkyl, (substituted) Ph; R1R2 can complete a 3-8 membered ring; R3 = C1-6 alkyl, substituted C1-4 alkyl, C3-7 cycloalkyl, C1-4 haloalkyl; R5 = H, C1-6 alkyl, substituted C1-4 alkyl, C2-6 alkenyl, C2-6 alkynyl, (substituted) C3-7 cycloalkyl, (substituted) Ph, etc.; R6 = H, C1-6 alkyl, C1-4 haloalkyl, (substituted) C1-4 alkoxy, C1-4 thioalkyl, etc.; R7 = H, C1-6 alkyl, C1-4 alkylthio, substituted C1-4 alkyl, C2-6 alkenyl, C2-6 alkynyl, etc.] were prepd. as agrochem. fungicides. Thus, NaOMe was added to a soln. of 4-chloro-2-(4-ethoxy-6-methylpyrid-2-yl)-6-methylpyrimidine in abs. MeOH under Ar and the mixt. was stirred for 30 h at room temp. to give 2-(4-ethoxy-6-methylpyrid-2-yl)-4-methoxy-6-methylpyrimidine (II). II at 125 ppm gave 100% control of Pircularia oryzae on rice.

1



①9 BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**
⑩ **DE 40 29 649 A 1**

⑳ Aktenzeichen: P 40 29 649.0
㉑ Anmeldetag: 19. 9. 90
㉒ Offenlegungstag: 26. 3. 92

㉓ Int. Cl.⁵:
C 07 D 401/04
C 07 D 401/14
C 07 D 413/14
// C 07 D 521/00
(C 07 D 401/04, 213:62,
239:24) (C 07 D
401/14, 213:62,
239:24, 211:06, 241:04)
(C 07 D 413/14, 213:62,
239:24, 265:30)

DE 40 29 649 A 1

㉔ Anmelder:
Hoechst AG, 6230 Frankfurt, DE

㉕ Erfinder:
Vermehren, Jan, Dr.; Giencke, Wolfgang, Dr., 6238
Hofheim, DE; Braun, Peter, Dr., 6500 Mainz, DE;
Sachse, Burkhard, Dr., 6233 Kelkheim, DE

㉖ Alkoxyipyridyl-pyrimidin-Derivate, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung
als Fungizide

DE 40 29 649 A 1

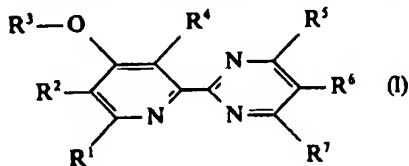
Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft Alkoxy-pyridyl-pyrimidin-Derivate, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung als Fungizide.

Pyrimidin-Derivate sind bereits als wirksame Komponenten in fungiziden Mitteln bekannt (vgl. EP-A-270 362, EP-A-259 139, EP-A-234 104). Die Wirkung dieser Pyrimidin-Derivate ist jedoch insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen nicht immer befriedigend.

Es wurden neue Pyrimidin-Derivate gefunden, die vorteilhafte Wirkungen bei der Bekämpfung eines breiten Spektrums phytopathogener Pilze insbesondere bei niedrigen Dosierungen aufweisen.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher Verbindungen der Formel I



worin

R^1 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkynyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu dreifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenylmercapto- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die vier letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein können, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^2 , R^4 = unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, Phenyl, wobei der Phenylrest bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein kann, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^1 und R^2 zusammen einen Teil eines maximal gesättigten 3- bis 8gliedrigen Ringes,

R^3 = (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein können, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^5 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkynyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu dreifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, (C_1-C_4) Haloalkyl, Halogen, Phenyl oder Phenyl- (C_1-C_4) alkyl wobei die zwei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein können, und Halo ein- oder Mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^6 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Thioalkyl, (C_2-C_4) Alkenyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_2-C_4) Alkynyl- (C_1-C_4) alkoxy, Halogen, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, wobei die drei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein können, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^7 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkynyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu dreifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_{18}) Alkoxy, (C_1-C_6) Alkylthio, Halogen, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenylthio- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkoxy, Phenyl- (C_1-C_4) alkylthio, wobei die acht letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Carboxyl, Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein können, (C_2-C_4) Alkenyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_2-C_4) Alkynyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, Phenyl- (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_6) Hydroxyalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkylthio, Amine der Formel NR^8R^9 oder Hydrazine der Formel $NH-NR^8R^9$, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^8 , R^9 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_6) Hydroxyalkyl, (C_3-C_7) Heterocycl- (C_1-C_6) alkyl, (C_2-C_4) Alkenyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_2-C_4) Alkynyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu zweifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, Formyl, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu zweifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, Carboxyl, (C_1-C_4) Alkoxy, Trifluormethyl oder Trichlormethyl substituiert sein können,

R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen unsubstituierten oder bis zu zweifach substituierten 5- bis 7gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 1 oder 2 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen substituiert bedeuten,

sowie deren Säureadditionssalze.

Bevorzugt unter den Verbindungen der Formel I sind solche, worin

R^1 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_2) alkyl, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_2) alkyl oder Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die drei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkoxy substituiert sein können.

R^2 bedeutet bevorzugt Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, Phenyl, das bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy substituiert sein kann,

R^1 und R^2 zusammen einen Teil eines maximal gesättigten 5- bis 7gliedrigen Ringes, und

R^3 bedeutet bevorzugt (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_2) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy oder (C_1-C_4) Haloalkyl substituiert sein können.

R^4 bedeutet bevorzugt Wasserstoff oder (C_1-C_4) Alkyl,

R^5 bedeutet bevorzugt Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl- (C_1-C_3) alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Halogen, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy oder (C_1-C_2) Haloalkyl substituiert sein können, und

R^6 bedeutet bevorzugt Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_2-C_4) Alkyl- (C_1-C_4) alkoxy, Halogen, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, wobei die drei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann.

R^7 bedeutet bevorzugt Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl- (C_1-C_3) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkyl, (C_1-C_18) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_2-C_6) Alkyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Hydroxyalkoxy, Phenyl- (C_1-C_2) alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkylthio, Halogen, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkoxy, Phenyl- (C_1-C_2) alkylthio, wobei die sechs letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Carboxyl, Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_2) Haloalkyl oder (C_1-C_3) Haloalkoxy substituiert sein können, Amine der Formel NR^8R^9 oder Hydrazine der Formel $NH-NR^8N^9$.

R^8 , R^9 bedeuten bevorzugt unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Hydroxyalkyl, (C_5-C_6) Heterocycl- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_3) Alkenyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_2-C_3) Alkyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl- (C_1-C_2) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu zweifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, Formyl, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu zweifach durch Halogen, (C_1-C_3) Alkyl, Carboxyl, (C_1-C_3) Alkoxy, Trifluormethyl oder Trichlormethyl substituiert sein können, oder

R^8 und R^9 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen unsubstituierten oder bis zu zweifach substituierten 5- bis 7gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocycl mit 1 oder 2 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen.

In der Formel I bedeuten

R^1 insbesondere Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-methyl, Phenyl, Phenoxy-methyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die drei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy substituiert sein können.

R^2 bedeutet insbesondere Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, Phenyl, wobei Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert sein kann, oder gemeinsam mit R^1 einen Teil eines maximal ungesättigten 5- bis 7gliedrigen Ringes bildet.

R^3 bedeutet insbesondere (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_2) alkyl, wobei der Phenylrest der beiden letzten Beispiele bis zu dreifach mit Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, oder (C_1-C_4) Haloalkyl substituiert sein kann, und

R^4 bedeutet insbesondere Wasserstoff oder (C_1-C_2) Alkyl.

R^5 bedeutet insbesondere Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl- (C_1-C_3) alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Halogen, Phenyl, Phenyl-methyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy oder (C_1-C_2) Haloalkyl substituiert sein können,

R^6 bedeutet insbesondere Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, Halogen, Phenyl, Phenyl-methyl, wobei der Phenylrest der beiden letzten Beispiele bis zu dreifach mit Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy oder (C_1-C_4) Haloalkyl substituiert sein kann, und

R^7 bedeutet insbesondere Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl-methyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkyl, (C_1-C_18) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl- (C_1-C_2) alkoxy, (C_2-C_6) Alkyl- (C_1-C_2) alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_2) alkoxy, (C_1-C_4) Hydroxyalkoxy, Halogen, Phenyl-methoxy- (C_1-C_4) alkoxy, Phenyl, Phenoxy, Phenylmercapto, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkoxy, Phenyl-methylthio, wobei die sieben letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Carboxyl, Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_2) Haloalkyl oder (C_1-C_3) Haloalkoxy substituiert sein können, Amine der Form NR^8R^9 oder Hydrazine der Form $NH-NR^8N^9$.

R^8 , R^9 bedeuten dabei insbesondere unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_2) Hydroxyalkyl, (C_5-C_6) Heterocycl- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_3) Alkenyl-methyl, (C_2-C_3) Alkyl-methyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl-methyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu zweifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, Formyl, Phenyl, Phenyl-methyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu zweifach durch Halogen, (C_1-C_3) Alkyl, (C_1-C_3) Alkoxy, Carboxyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl substituiert sein können, oder

R⁸, R⁹ stehen zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen bis zu zweifach substituierten 5- oder 6gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclen mit 1 oder 2 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen, besonders bevorzugt mit den Heteroatomen Stickstoff und/oder Sauerstoff und dem Substituenten (C₁–C₂)Alkyl.

Die Alkyl-, Alkenyl- oder Alkynylreste können sowohl geradkettig als auch verzweigt sein. Halogen bedeutet F, Cl, Br, J, bevorzugt F, Cl, Br. Die Vorsilbe "Halo" in der Bezeichnung eines Substituenten bedeutet, daß dieser Substituent einfach oder mehrfach bei gleicher oder verschiedener Bedeutung auftreten kann. Die Vorsilbe "Halo" beinhaltet Fluor, Chlor, Brom oder Jod, vorzugsweise Fluor, Chlor oder Brom. Als Beispiele für Halogenalkane seien genannt: CF₃, CF₂CHF₂, CCl₃, CCl₂F, CF₂CF₂CF₃, CF₂CHF₂CF₃, CH₂CF₃ und (CH₂)₃CF₃.

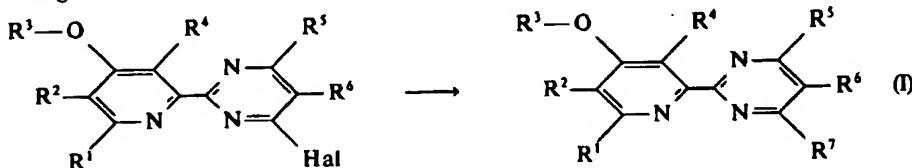
Zur Herstellung der Säureadditionssalze der Verbindungen der Formel I kommen folgende Säuren in Frage:

Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoffsäure oder Bromwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Salpetersäure, Schwefelsäure, mono- oder bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren wie Essigsäuren, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Citronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure oder Milchsäure, sowie Sulfonsäuren wie p-Toluolsulfonsäure oder 1,5-Naphthalindisulfonsäure. Die Säureadditionssalze der Verbindungen der Formel I können in einfacher Weise nach üblichen Salzbildungsmethoden, z. B. durch Lösen in einem organischen Lösungsmittel und Hinzufügen der Säure erhalten werden und in bekannter Weise, z. B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenenfalls durch Waschen mit einem inerten Lösungsmittel gereinigt werden.

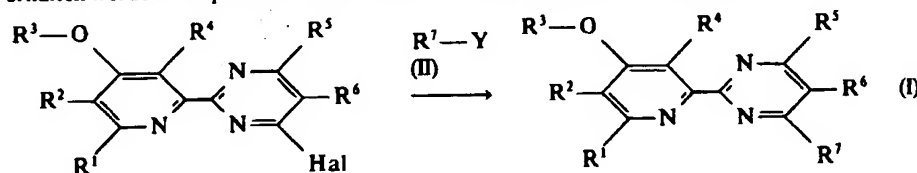
Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist auch ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I.

Die Alkoxypyridyl-pyrimidin-Derivate der Formel I können nach den folgenden Methoden hergestellt werden:

a) Pyrimidin-Derivate der Formel I mit R⁷ = H können entsprechend der folgenden Reaktionsgleichung durch reduktive Dehalogenierung von entsprechenden Halopyrimidinen, in denen Hal für Halogen (Cl, Br, J) steht und die restlichen Substituenten wie in Formel I definiert sind, erhalten werden. Die Dehalogenierung kann mit Wasserstoff in Gegenwart von Katalysatoren (z. B. Palladium/Kohle) in einem inerten Lösungsmittel z. B. Wasser, niedriger Alkohol (wie Methanol und Ethanol), Ethylacetat oder Toluol oder Gemischen derselben durchgeführt werden. Vorteilhaft ist die Zugabe von Basen wie Alkali- oder Erdalkalihydroxide oder -carbonate. Die Reaktion wird vorzugsweise im Bereich von 15°C bis 60°C unter einem Wasserstoff-Druck von 1 bis 5 bar durchgeführt.



b) Pyrimidin-Derivate der Formel I, worin R⁷ = (C₁–C₁₈)Alkoxy, (C₁–C₃)Alkylthio, (C₂–C₆)Alkenyl-, (C₁–C₄)alkoxy, (C₂–C₆)Alkynyl-, (C₁–C₄)alkoxy, (C₁–C₄)Haloalkoxy, (C₁–C₄)alkoxy-(C₁–C₄)alkoxy, Phenyl-, (C₁–C₂)alkoxy-(C₁–C₄)alkoxy, (C₁–C₄)Alkylthio-(C₁–C₄)alkylthio, Phenoxy, Phenylmercapto, Phenyl-, (C₁–C₂)alkoxy, Phenyl-(C₁–C₂)alkylthio, wobei die vier letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C₁–C₄)Alkyl, (C₁–C₄)Alkoxy, (C₁–C₂)Haloalkyl oder (C₁–C₃)Haloalkoxy substituiert sein können, bedeutet, können durch Reaktion von entsprechenden Halopyrimidinen mit einer Alkalimetallverbindung der Formel R⁷–Y (II), worin R⁷ wie oben angegeben definiert ist und Y = ein Alkalimetall bedeutet, erhalten werden. Beispiele für Alkalimetalle sind Natrium, Kalium und Lithium.

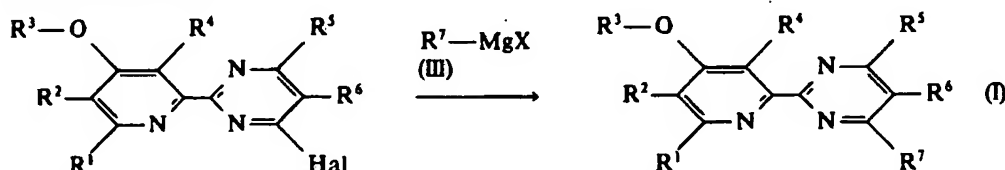


Die Reaktion kann zwischen 0°C und 130°C innerhalb von 0,5 bis 72 Stunden durchgeführt werden. Die Alkalimetallverbindung R⁷–Y kann in Mengen von 1 bis 2 Moläquivalenten, bezogen auf 1 Äquivalent des Halopyrimidins, eingesetzt werden. Die Reaktionen werden in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt.

In den Fällen, in denen eine Alkalimetallverbindung R⁷–Y eingesetzt wird, worin R⁷ = (C₁–C₁₈)Alkoxy, (C₂–C₆)Alkenyl-, (C₁–C₄)alkoxy, (C₂–C₆)Alkynyl-, (C₁–C₄)alkoxy, (C₁–C₄)Haloalkoxy, (C₁–C₄)alkoxy-(C₁–C₄)alkoxy, Phenyl-, (C₁–C₂)alkoxy-(C₁–C₄)alkoxy, oder Phenyl-(C₁–C₂)alkoxy bedeutet, wird zweckmäßigerweise der korrespondierende Alkohol R⁷ oder ein Ether (z. B. Diethylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran) oder eine Mischung derselben als Lösungsmittel benutzt. In den Fällen, in denen eine Alkalimetallverbindung R⁷–Y eingesetzt wird, worin R⁷ = (C₁–C₃)Alkylthio, (C₁–C₄)Alkylthio-(C₁–C₄)alkylthio, Phenoxy, Phenylmercapto, Phenyl-(C₁–C₂)alkylthio bedeutet, wird ein Ether (z. B. Diethylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran), ein Nitril (z. B. Acetonitril), ein aromatischer Kohlenwasserstoff (z. B. Toluol oder Xylol) oder eine Mischung derselben als Lösungsmittel verwendet.

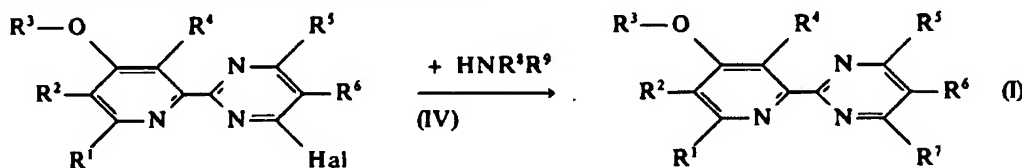
c) Pyrimidin-Derivate der Formel I, worin R⁷ = (C₁–C₆)Alkyl, Phenyl-(C₁–C₂)alkyl, (C₃–C₆)Cycloalkyl, (C₅–C₆)Cycloalkyl-(C₁–C₃)alkyl, (C₂–C₆)Alkenyl, (C₂–C₆)Alkynyl oder Phenyl bedeutet, wobei der letztge-

nannte Rest bis zu dreifach durch (C₁–C₄)Alkyl oder (C₁–C₄)Alkoxy substituiert sein kann, können durch Umsetzung von entsprechenden Halopyrimidinen mit Grignardverbindungen R⁷–MgX (III), wobei R⁷ wie oben angegeben definiert ist und X für Halogen (Cl, Br, I) steht, in Gegenwart eines Katalysators, beispielsweise 1,2-Bis-(diphenylphosphino)-ethan-nickel-(II)-chlorid oder 1,2-Bis-(diphenylphosphino)-propan-nickel-(II)-chlorid erhalten werden (vgl. Chem. Pharm. Bull 26, 2160 (1978) und Pure & Appl. Chem. 52, 669 (1980)). Die Reaktion kann zwischen 0°C und 80°C bzw. beim Siedepunkt des Lösungsmittels durchgeführt werden. Die Grignardverbindung R⁷–MgX kann in Mengen von 1 bis 2,5 Moläquivalenten, bezogen auf 1 Äquivalent Halopyrimidin, eingesetzt werden. Als Lösungsmittel eignen sich Ether, beispielsweise Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Dimethoxyethan.



d) Pyrimidin-Derivate der Formel I, worin der Rest R⁷ = NR⁸R⁹ bedeutet und wie oben in der allgemeinen Formel I angegeben definiert sind, können durch die Umsetzung von entsprechenden Halopyrimidinen mit primären oder sekundären Aminen der Formel HNR⁸R⁹ (IV), wobei R⁸ und R⁹ wie oben angegeben definiert sind und X für Halogen (Cl, Br, I) steht, erhalten werden.

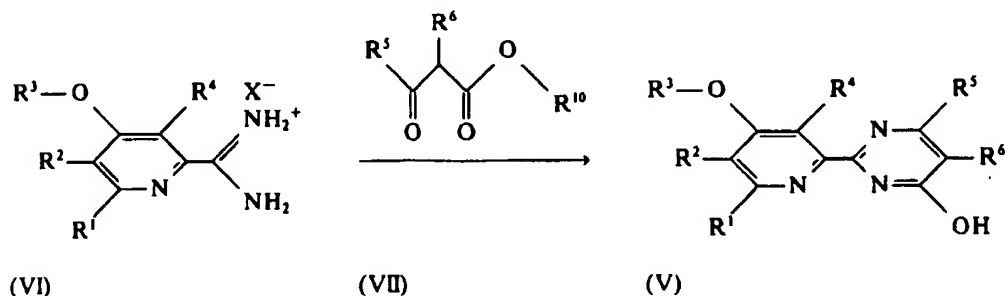
Die Umsetzung erfolgt vorzugsweise im Amin der Formel IV selbst, oder in inerten aprotischen Lösungsmitteln wie z. B. Acetonitril, Dichlormethan, Toluol, Xylol, Tetrahydrofuran, Dioxan, Dialkylether oder DMF bei Temperaturen zwischen –10°C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels innerhalb von 0,5 bis 72 Stunden in Gegenwart einer Base. Als Basen eignen sich die für diesen Reaktionstyp üblichen Basen wie Carbonate und Hydrogencarbonate von Alkali- und Erdalkalimetallen, Alkalihydroxide, tert.-Amine, Pyridin oder substituierte Pyridinbase (z. B. 4-Dimethylaminopyridin). Auch ein zweites Äquivalent der Verbindungen der Formel HNR⁸R⁹ kann die Funktion der Base übernehmen.



Die Halopyrimidine können durch Umsetzung der entsprechenden Hydroxypyrimidine der Formel V, worin die Reste R¹–R⁶ wie in der allgemeinen Formel I definiert sind, mit Halogenierungsreagenzien erhalten werden. Als Halogenierungsreagenz können z. B. Thionylchlorid, Phosgen, Phosphorylchlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphorylbromid oder Phosphortribromid eingesetzt werden. Die Reaktionen können in einem Lösungsmittel, aber auch ohne Lösungsmittel durchgeführt werden.

Das Halogenierungsreagenz kann in Mengen von 1 bis 4 Äquivalenten, bezogen auf 1 Äquivalent des Hydroxypyrimidins (V), eingesetzt werden. Die Reaktionen können in einem Temperaturbereich von 25°C bis 160°C durchgeführt werden. Als Lösungsmittel werden z. B. aromatische Kohlenwasserstoffe (z. B. Benzol oder Toluol, u. a.) oder halogenierte Kohlenwasserstoffe (z. B. Chlorbenzol, Dichlormethan oder 1,2-Dichlorethan) eingesetzt.

Die Hydroxypyrimidine (V) können durch Kondensation der Amidin-Derivate (VI) mit β-Oxocarboxylaten der Formel VII dargestellt werden,



worin die Reste R¹–R⁶ wie in Formel I definiert sind, X für Halogen (Chlor, Brom, Jod) und R⁹ für niedere Alkylreste, z. B. Methyl, Ethyl oder Propyl, stehen.

Die Reaktionen werden im Temperaturbereich von 20–110°C bzw. beim Siedepunkt des Lösungsmittels innerhalb von 2 bis 72 Stunden durchgeführt. Das β-Oxocarboxylat kann in Mengen von 1–1,5 Äquivalenten, bezogen auf ein Äquivalent Amidin-Derivat (VI), eingesetzt werden. Die Reaktion wird in Gegenwart einer Base und eines Lösungsmittels durchgeführt. Als Basen können anorganische Basen, wie Alkalimetallhydroxide und -carbonate, oder organische Basen, wie Natriumalkoxide, Trialkylamine und N,N-Dialkylaniline, eingesetzt

werden. Als Lösungsmittel eignen sich niedere Alkohole (wie z. B. Methanol und Ethanol), cyclische Ether (wie Dioxan und THF), Pyridin, N,N-Dimethylformamid, Wasser oder Gemische derselben.

Die Amidin-Derivate der Formel VI und die β -Oxocarboxylate der Formel VII können nach bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. J. Org. Chem. 32, 1591 (1967) bzw. Synthesis 1982, 451 und Organikum 1986, 516 ff.).

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I zeichnen sich durch eine hervorragende fungizide Wirkung aus. Bereits in das pflanzliche Gewebe eingedrungene pilzliche Krankheitserreger lassen sich erfolgreich kurativ bekämpfen. Dies ist besonders wichtig und vorteilhaft bei solchen Pilzkrankheiten, die nach eingetretener Infektion mit den sonst üblichen Fungiziden nicht mehr wirksam bekämpft werden können. Das Wirkungsspektrum der beanspruchten Verbindungen erfaßt eine Vielzahl verschiedener wirtschaftlich bedeutender, phytopathogener Pilze, wie z. B. *Piricularia oryzae*, *Leptosphaeria nodorum*, *Pyrenophora teres*, echte Mehltauarten, *Phytophthora infestans*, verschiedene Rostpilze und *Botrytis cinerea*. Besonders gut werden Benzimidazol- und Dicarboximid-sensible und -resistente *Botrytis cinerea*-Stämme erfaßt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen eignen sich daneben auch für den Einsatz in technischen Bereichen, beispielsweise als Holzschutzmittel, als Konservierungsmittel in Anstrichfarben, in Kühlschmiermitteln für die Metallbearbeitung oder als Konservierungsmittel in Bohr- und Schneidölen.

Gegenstand der Erfindung sind auch Mittel, die die Verbindungen der Formel I neben geeigneten Formulierungsmitteln enthalten. Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die Wirkstoffe der Formel I im allgemeinen zu 1 bis 95 Gew.-%.

Sie können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem wie es durch die biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben ist. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen daher in Frage: Spritzpulver (WP), emulgierbare Konzentrate (EC), wäßrige Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis (SC), Suspoemulsionen (SC), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate in Form von wasserdispergierbare Granulate (WG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln, Wachse oder Köder.

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986; van Falkenberg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N. Y., 2nd Ed. 1972—73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden beispielsweise beschrieben in:

Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carrier", 2nd Ed., Darland Book, Caldwell N. J.; Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry, 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N. Y.; Marschen, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N. Y. 1950; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp. Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxiaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z. B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix.

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Netzmittel, z. B. polyoxethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fetalkohole, Alkyl- oder Alkylphenol-sulfonate und Dispergiermittel, z. B. ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutyl-naphthalinsulfonsaures Natrium oder auch oleylmethyltaurinsäures Natrium enthalten. Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel, z. B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt.

Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsäure Calcium-Salze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylaryl-polyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Sorbitanfettsäureester, Polyoxethylensorbitan-Fettsäureester oder Polyoxethylensorbitester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z. B. Talkum, natürlichen Tonen wie Kaolin, Bentonit, Poryphillit oder Diatomeenerde. Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z. B. Polyvinylalkohol, polyacrylsäurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise — gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln — granuliert werden.

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z. B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubbörmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z. B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser.

Staubförmige und granuliert Zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit u. a. variiert die erforderliche Aufwandmenge. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken. Sie liegt zwischen 0,005 und 10,0 kg/ha Wirkstoff, vorzugsweise jedoch zwischen 0,01 und 5 kg/ha Wirkstoff.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen entweder allein oder in Kombination mit weiteren, literaturbekannten Fungiziden angewendet werden.

Als literaturbekannte Fungizide, die erfindungsgemäß mit den Verbindungen der Formel I kombiniert werden können, sind z. B. folgende Produkte zu nennen:

Imazalil, Prochloraz, Fenapanil, SSF 105, Triflumizol, PP 969 Flutiafol, BAY-MEB 6401, Propiconazol, Etaconazol, Tebuconazol, Diclobutrazol, Bitertanol, Triadimefon, Triadimenol, Fluotrimazol, Dimethomorph, Tridemorph, Dodemorph, Fenpropimorph, Falimorph, S-32165, Chlobenzthiazole, Parinol, Butiobat, Fenpropidin, Triforine, Fenarimol, Nuarimol, Triarimol, Ethirimol, Dimethirimol, Bupirimate, Rabenzazole, Tricyc lazole, Fluobenzimine, Pyroxyfur, NK-483, PP-389, Pyroquilon Hymexazole, Fenitropan, UHF-8227, Cymoxanil, Dichlofunanid, Captafol, Captan, Folpet, Tolyfluand, Chlorothalonil, Etridiazol, Iprodione (Formel II), Procymidon, Vinclozol, Metomeclan, Myclozolin, Dichlozolate, Fluorimide, Drazoxolan, Chinomethionate, Nitrothalisopropyl, Dithianon, Dinocap, Binapacryl, Fentinacetate, Fentinhydroxide, Carboxin, Oxycarboxin, Pyracarolid, Methfuroxam, Fenfura, Furmecyclos, Benodanil, Mebenil, Mepronil, Flutalanil, Fuberidazole, Thiabendazole, Carben-dazim, Benomyl, Thiofante, Thiofanatemethyl, CGD-95340 F, IKF-1216, Mancozeb, Maneb, Zineb, Nabam, Thiram, Probineb, Prothiocarb, Propamocarb, Dodine, Guazatine, Dicloran, Quintozene, Chloroneb, Tecnazene, Biphenyl, Anilazine, 2-Phenylphenol, Kupferverbindungen wie Cu-oxychlorid, Oxine-Cu, Cu-oxide, Schwefel, Foseethylaluminium, Natrium-dodecylbenzolsulfonat, Natrium-dodecylsulfat, Natrium-C13/C15-alkoholether-sulfonat, Natrium-cetostearylphosphat, Diocetyl-natriumsulfosuccinat, Natrium-isopropyl-naphthalinsulfon-at, Natrium-methylenbisnaphthalinsulfonat, Cetyl-trimethyl-ammoniumchlorid, Salze von langkettigen primä-ren, sekundären oder tertiären Aminen, Alkyl-propylenamine, Lauryl-pyridinium-bromid, ethoxilierte quater-nierte Fettamine, Alkyl-dimethyl-benzylammoniumchlorid und 1-Hydroxyethyl-2-alkyl-imidazolin.

Die oben genannten Kombinationspartner stellen bekannte Wirkstoffe dar, die zum großen Teil in CH. R. Worthing, U.S.B. Walker und The Pesticide Manual, 7. Aufl. (1983), British Crop Protection Council beschrieben sind.

Darüber hinaus können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbon-säureester, Formamidine, Zinnverbindungen, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u. a.

Bevorzugte Mischungspartner sind:

1. aus der Gruppe der Phosphorsäureester Azinphos-ethyl, Azinphosmethyl, 1-(4-Chlorphenyl)-4-(O-ethyl, s-propyl)-phosphoryloxypyrazol (TIA-230), Chlorpyrifos, Coumaphos, Demeton, Demeton-S-methyl, Diazinon, Dichlorvos, Dimethoat, Ethoprophos, Etrifos, Fenitrothion, Fenthion, Heptenophos, Parathion, Parathion-methyl, Phosalon, Pirimiphos-ethyl, Pirimiphos-methyl, Profenofos, Prothiofos, Sulprofos, Triazophos, Trichlorph-on.

2. aus der Gruppe der Carbamate

Aldicarb, Bendiocarb, BPMC (2-(1-Methylpropyl)-phenylmethylcarbam), Butocarboxim, Butoxycarboxim, Car-baryl, Carbofuran, Carbosulfan, Cloethocarb, Isoprocacarb, Methomyl, Oxamyl, Primicarb, Promecarb, Propoxur, Thiodicarb.

3. aus der Gruppe der Carbonsäureester

Allethrin, Alphamethrin, Bioallethrin, Bioresmethrin, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cypermethrin, Del-tamethrin, 2,2-Dimethyl-3-(2-chlor-2-trifluormethylvinyl)-cyclopropan-carbonsäure-(alpha-cyano-3-phenyl-2-me-thyl-benzyl)-ester (FMC 54800), Fenprothrin, Fenluthrin, Fenvalerat, Flucythrinate, Flumethrin, Fluvalinate, Permethrin, Resmethrin, Tralomethrin.

4. aus der Gruppe der Formamidine

Amitraz, Chlordimeform

5. aus der Gruppe der Zinnverbindungen

Azocyclotin, Cyhexatin, Fenbutatinoxid

6. Sonstige

Abamectin, Bacillus thuringiensis, Bensultap, Binapacryl, Bromopropylate, Buprofecin, Camphechlor, Cartap, Chlorbenzilate, Chlorfluazuron, 2-(4-Chlorphenyl)-4,5-diphenylthiophen (UBI-T 930), Chlofentezine, Cyclopro-pan-carbonsäure(2-naphthylmethyl)-ester Ro 12-0470 Cyromacin, DDT, Dicozol, N-(3,5-Dichlor-4-(1,1,2,2-tetra-fluoroethoxy)phenylamino)carbonyl-2,6-difluorbenzamide (XRD 473), Diflubenzuron, N-(2,3-Dihydro-3-me-thyl-1,2-thiazol-2-ylidene)-2,4-xylydine, Dinobuton, Dinocap, Endosulfan, Fenoxycarb, Fenthocarb, Flubenzimine, Flufenoxuron, Gamma-HCH Hexythiazox, Hydramethylnon (AC 217 300) Ivermectin, 2-Nitromethyl-4,5-dihy-dro-6H-thiazin (SD 52618), 2-Nitromethyl-3,4-dihydrothiazol (SD 35651), 2-Nitromethylene-1,3-thiazinan-3-yl-carbomaldehyde (WL 108 477), Propargite, Teflubenzuron, Tetradifon, Tetrasul, Thicyclam, Triflumarol Kern-polyeder- und Granuloseviren.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren, die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0001 bis zu 100 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise von 0,001 bis 1 Gew.-% liegen. Die Anwendung geschieht in einer den Anwen-dungsformen angepaßten üblichen Weise.

Nachfolgende Beispiele dienen zur Erläuterung der Erfindung.

A. Formulierungsbeispiele

- a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile Wirkstoff und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- 5 b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gew.-Teile Wirkstoff, 65 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
- c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat stellt man her, indem man 40 Gew.-Teile Wirkstoff mit 7 Gew.-Teilen eines Sulfobernsteinsäurehalbesters, 2 Gew.-Teilen eines Ligninsulfonsäure-Natriumsalzes und 51 Gew.-Teilen Wasser mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikro vermahlt.
- 10 d) Ein emulgierbares Konzentrat läßt sich herstellen aus 15 Gew.-Teilen Wirkstoff, 75 Gew.-Teilen Cyclohexan als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertem Nonylphenol (10 AeO) als Emulgator.
- e) Ein Granulat läßt sich herstellen aus 2 bis 15 Gew.-Teilen Wirkstoff und einem inerten Granulatträgermaterial wie Attapulgit, Bimsgranulat und/oder Quarzsand. Zweckmäßigerweise verwendet man eine Suspension des Spritzpulvers aus Beispiel b) mit einem Feststoffanteil von 30% und spritzt diese auf die Oberfläche eines Attapulgitgranulats, trocknet und vermischt innig. Dabei beträgt der Gewichtsanteil des Spritzpulvers ca. 5% und der des inerten Trägermaterials ca. 95% des fertigen Granulats.

B. Chemische Beispiele

Beispiel 1

2-(4-Ethoxypyrid-2-yl)-4-methylpyrimidin

- 25 Zu einer Lösung von 3,0 g (0,012 mol) 4-Chlor-2-(4-ethoxy-pyrid-2-yl)-6-methylpyrimidin in 50 ml Methanol wurden 0,2 g Palladium/Kohle zugefügt. Unter einem Druck von 3 bar und einer Temperatur von 60°C wurde dieses Gemisch unter starkem Rühren 6 Stunden in Kontakt mit Wasserstoff gebracht. Anschließend wurde der Katalysator abfiltriert und das Filtrat im Vakuum eingeeengt. Der Rückstand wurde über Kieselgel mit Ethylacetat chromatographiert, eingeeengt und getrocknet. Man erhielt 1,2 g (46,5%) eines beigen Pulvers mit dem Schmelzpunkt 168°C.

Beispiel 2

2-(4-Ethoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-4-methoxy-6-methylpyrimidin

- 35 Zu einer Lösung von 1,6 g (0,0061 mol) 4-Chlor-2-(4-ethoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-6-methylpyrimidin in 20 ml absolutem Methanol wurden unter Argon 1,6 g (0,009 mol) einer 30%igen Lösung von Natriummethylat in Methanol gegeben. Es wurde 30 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, das Lösungsmittel abdestilliert, in Wasser aufgenommen und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Na₂SO₄ getrocknet und eingeeengt. Es wurden 1,5 g (96,7%) eines braunen Öls erhalten.

Beispiel 3

5-Methoxy-2-(4-methoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-4-propinyl-amino-pyrimidin

- 45 Zu einer Lösung von 1,24 g (0,005 mol) 4-Chlor-5-methoxy-2-(4-methoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-pyrimidin und 0,549 g (0,005 mmol) N-Methylmorpholin in 20 ml abs. THF wurden 0,342 g (0,005 mol) Propargylamin zugefügt und 18 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Anschließend wurde eingeeengt, auf Wasser gegeben und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde getrocknet (MgSO₄) und eingeeengt. Flash-Chromatographie mit Kieselgel und Ethylacetat/Methanol (98/2) lieferte 1,0 g (70,4%) gelbliche Kristalle, die bei 146–148°C unter Zersetzung schmolzen.

Beispiel 4

4-Butylthio-2-(4-ethoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-6-propyl-pyrimidin

- 55 Zu einer Lösung von 1,07 ml (0,01 mol) Butylmercaptan in 20 ml abs. THF wurden bei Raumtemperatur unter Argon 0,3 g (0,01 mol) einer 80%igen Suspension von Natriumhydrid in Paraffin gegeben und 2 Stunden gerührt. Dann wurden 1,45 g (0,005 mol) 4-Chlor-2-(4-ethoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-6-propylpyrimidin zugesetzt und bei Raumtemperatur 6 Stunden gerührt. Anschließend wurde eingeeengt, das Gemisch auf Wasser gegeben, mit Ethylacetat extrahiert, die organische Phase über MgSO₄ getrocknet, eingeeengt und getrocknet. Man erhielt 0,7 g (81,4%) eines gelblichen Öls.

Beispiel 5

2-(4-Ethoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-6-methyl-4-propylpyrimidin

Zu einer Suspension von 50 mg (0,00009 mol) 1,3-Bis-(diphenylphosphino)-propan-nickel-(II)-chlorid und 1,0 g (0,003 mol) 4-Chlor-2-(4-ethoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-6-propylpyrimidin in 20 ml abs. Diethylether wurden unter Argon bei 0°C 2 ml einer 3-molaren Lösung (0,006 mol) von Methylmagnesiumbromid in Diethylether unter intensivem Rühren zugetropft. Es wurde 8 Stunden unter Rückfluß erhitzt und anschließend 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Es wurde auf verdünnte Salzsäure gegossen, 30 Minuten gerührt und mit NaCO₃ neutralisiert. Die organische Phase wurde getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde Flash-chromatographiert (Kieselgel, Ethylacetat)

Beispiel 6

4-Chlor-5-methoxy-2-(4-methoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-pyrimidin

Zu einer Lösung von 49,4 g (0,20 mol) 5-Methoxy-2-(4-methoxy-6-methyl-pyrid-2-yl)-pyrimidin-4-on in 500 ml abs. Dichlorethan wurde bei 0°C 61 g (0,4 mol) Phosphoroxychlorid gegeben und 6 Stunden bei 40°C gerührt. Anschließend wurde das Lösungsmittel weitgehend abgezogen, unter intensivem Rühren auf 10%ige Natriumcarbonatlösung gegossen und die basische Lösung mit Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wurde getrocknet (MgSO₄), eingeeengt und getrocknet. Man erhielt 46,4 g (87%) eines weißen Pulvers vom Schmelzpunkt 145–146°C.

Analog zu diesen Beispielen lassen sich die Verbindungen der Tabelle 1 herstellen.

Die Wasserstoff-Position der ¹H-NMR-Spektren werden wie nachfolgend aufgeführt belegt:

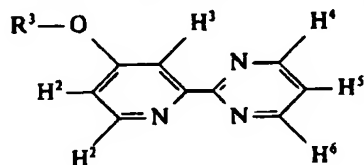









Tabelle I

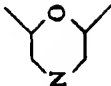



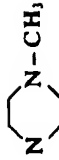
Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
1.01	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	H	Fp. 168°C Zers.
1.02	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	OCH ₃	Fp. 74–76°C
1.03	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-n-C ₄ H ₉	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 1,0 (t); 1,30–2,00 (m); 2,55 (s); 4,17 (q); 4,45 (t); 6,55 (s); 6,88 (dd); 7,95 (d), 8,65 (d)
1.04	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-CH ₂ -CH=CH ₂	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 1,45 (t); 2,60 (s); 4,20 (q); 5,00 (m); 5,20–5,60 (m); 5,88–6,30 (m); 6,60 (s); 6,85 (dd); 7,95 (d); 8,63 (d)
1.05	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-CH ₂ -C≡CH	Fp. = 112°C
1.06	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-CH(CH ₃)-C≡CH	Fp. 133–134°C
1.07	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-C ₆ H ₅	Fp. = 84–86°C
1.08	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	
1.09	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 1,33–1,58 (m); 2,58 (s); 4,15 (q); 4,63 (q); 6,55–6,88 (dd); 7,95 (d); 8,63 (d)
1.10	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	OC ₂ H ₅	
1.11	H	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ -C ₆ H ₅	OCH ₃	
1.12	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-CH ₂ -CH ₂ -OH	
1.13	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -C ₆ H ₅	n _D ²⁰ = 1,5647






Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
2.01	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NHCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 8,57 (d), H ¹ ; 7,95 (d), H ² ; 6,83 (dd), H ² ; 6,14 H ⁵
2.02	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	N(C ₂ H ₅) ₂	
2.03	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	N(C ₂ H ₅) ₂	
2.04	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	N(C ₂ H ₅) ₂	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 8,56 (d) H ¹ ; 7,90 (d), H ² ; 6,82 (dd), H ² (s), H ⁵ Fp. = 105-106°C
2.05	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NH-n-C ₄ H ₉	
2.06	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H		
2.07	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NH-CH ₂ -(4-CF ₃ -C ₆ H ₄)	Fp. = 97-100°C
2.08	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	N(CH ₃)-C ₆ H ₅	Fp. = 152°C
2.09	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃		Fp. = 226°C Fp. = 38-40°C
2.10	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NH-C ₆ H ₅ + HCl	
2.11	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NH-CH ₂ -C≡CH	
2.12	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NH-CH ₂ -C≡CH	Fp. = 250°C (Zers.) Fp. = 124-125°C
2.13	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NH-(2-COOH-C ₆ H ₄)	
2.14	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	N(CH ₃) ₂	
2.15	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅		n _D ²⁰ = 1,5820 Fp. = 107-111°C
2.16	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H		
2.17	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	S-C ₆ H ₅	

65 60 55 50 45 40 35 30 25 20 15 10 5

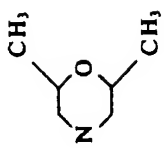
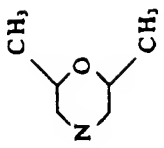
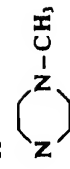
Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
2.18	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	Fp. = 99–102°C
2.19	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	Fp. = 69–70°C
2.20	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H	OCH ₃	
2.21	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H	OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 8,51 (d), H ¹ ; 7,75 (d), H ³ , 7,16 (dd), H ² ; 6,24, H ⁵
2.22	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H	O-CH ₂ -C≡CH	n _D ²⁰ = 1,5495
2.23	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	CH ₃	H	Fp. = 146–147°C
2.24	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H	H	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 8,63 (d), H ¹ ; 7,98 (d), H ³ , 6,85 (dd), H ² ; 6,63, H ⁵
2.25	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H	O-CH ₂ -C ₆ H ₅	
2.26	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H	O-(4-Cl-C ₆ H ₄)	
2.27	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	CH ₃	N(C ₂ H ₅) ₂	Fp. = 81–82°C
2.28	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H	NH-n-C ₄ H ₉	Fp. = 92–93°C
2.29	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H	N(C ₂ H ₅) ₂	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 8,57 (d), H ¹ ; 8,00 (d), H ³ , 6,83 (dd), H ² ; 6,25 (s), H ⁵
2.30	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H	NH-CH ₂ -C≡CH	Fp. = 69–70°C
2.31	H	H	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇	H		¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,78 (d), H ¹ ; 6,73 (d), H ³ , 6,55 (s), H ⁵
3.01	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	OCH ₃	Fp. = 74–76°C
3.02	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-C ₂ H ₅	
3.03	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	OCH ₃	O-CH ₂ -C≡CH	
3.04	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-CH ₂ -CH=CH ₂	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,78 (d), H ¹ ; 6,73 (d), H ³ , 6,60 (s), H ⁵
3.05	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-CH ₂ -CH=CH ₂	



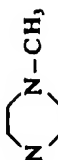
Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
3.06	CH ₃ -C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	O-CH ₂ -CH=CH ₂	Fp. = 127-128°C
3.07	CH ₃ -C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	OCH ₃	
3.08	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-CH ₂ -C≡CH	
3.09	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	OCH ₃	
3.10	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	H	Fp. = 84-85°C Fp. = 130-131°C
3.11	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	C ₂ H ₅	H	H	Br	Cl	
3.12	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	Cl	
3.13	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	OCH ₃	H	
3.14	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Fp. = 55-57°C Fp. = 56-57°C Fp. = 118-120°C
3.15	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ -C ₆ H ₅	
3.16	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	Cl	
3.17	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NH-CH ₂ -C≡CH	
3.18	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	N(C ₂ H ₅) ₂	Fp. = 121-124°C
3.19	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	N(C ₂ H ₅) ₂	
3.20	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	Cl	
3.21	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H		
3.22	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NH-CH ₂ -(4-CF ₃ -C ₆ H ₄)	Fp. = 117-120°C n _D ²⁰ = 1,5630
3.23	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H		
3.24	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	Cl	
3.25	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H	
3.26	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	S-C ₆ H ₅	Fp. = 117-120°C n _D ²⁰ = 1,5630
3.27	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	CH ₃	N(CH ₂ -CH=CH ₂) ₂	
3.28	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	N(C ₂ H ₅) ₂	



Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
3.29	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H		
3.30	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉	H	CH ₃	H		
3.31	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	C ₂ H ₅	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H		Fp. = 88-90°C
3.32	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	SCH ₃	Fp. = 84°C
3.33	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H		
3.34	C ₆ H ₅	H	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	CH ₃	H	N(C ₂ H ₅) ₂	
3.35	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃		
3.36	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	H	H	H	
3.37	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	NH-n-C ₄ H ₉	Fp. = 120-123°C
3.38	CH ₃	H	CF ₃ -CH ₂	H	CH ₃	H	OCH ₃	
3.39	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	H	H	Cl	
3.40	C ₆ H ₅	H	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	CH ₃	H	Cl	Fp. = 215-216°C
3.41	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	NH-C ₆ H ₅	
3.42	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	CH ₃	O-CH ₂ -C≡CH	
3.43	C ₆ H ₅	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -C≡CH	
3.44	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	O-CH ₂ -C≡CH	Fp. = 95-96°C
3.45	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,77 (d), H ¹ ; 6,74 (d), H ² ; 6,55 (s), H ³
3.46	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	O-CH ₂ -CH=CH ₂	


Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
3.47	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,77 (d), H ¹ ; 6,75 (d), H ² ; 6,60 (s), H ³
3.48	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ -C ₆ H ₅	
3.49	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	CH ₃	S-CH ₂ -C ₆ H ₅	
3.50	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	O-CH ₂ -CH=CH ₂	
3.51	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	C ₄ H ₉	H	n-C ₃ H ₇	H	O-n-C ₆ H ₁₇	Fp. = 57-58°C Öl, ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,75 (d), H ¹ ; 6,75 (d), H ² ; 6,55 (s), H ³
3.52	CH ₃	H	C ₄ H ₉	H	-(CH ₂) ₃ - 	H	O-n-C ₆ H ₁₇	
3.53	C ₆ H ₅	H	C ₄ H ₉	H	-(CH ₂) ₃ - 	H	Cl	
3.54	C ₆ H ₅	H	C ₄ H ₉	H	-(CH ₂) ₃ - 	H	H	
3.55	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	O-n-C ₆ H ₁₇	Fp. = 36°C
3.56	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	O-n-C ₆ H ₁₇	
3.57	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	C ₂ H ₅	H		H	O-n-C ₆ H ₁₇	
3.58	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	O-n-C ₆ H ₁₇	
3.59	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	NH-C ₆ H ₁₇	Öl, ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,73 (d), H ¹ ; 6,75 (d), H ² ; 6,62 (s), H ³
3.60	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	CH ₃	NH-CH ₂ -C ₆ H ₅	
3.61	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	O-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -OCH ₃	
3.62	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	CH ₃	
3.63	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	H		H	S-n-C ₄ H ₉	

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
3.64	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	S-n-C ₄ H ₉	Öl, ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,79 (d), H ¹ ; 7,00 (s), H ² , 6,75 (d), H ² Fp. = 137-138°C
3.65	CH ₃	H	C ₄ H ₉	H	n-C ₃ H ₇	CH ₃	Cl	
3.66	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	Br	
3.67	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	C ₄ H ₉	H	CH ₃	CH ₃	H	
3.68	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	Cl	O-CH ₂ -C ₄ H ₉	
3.69	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₄ H ₉	H	CH ₃	
3.70	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	NH-CH ₂ -C≡CH	
3.71	CH ₃	H	C ₄ H ₉	H	H	H	H	
3.72	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	NH-CH ₂ -C≡CH	
3.73	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	H	
3.74	CH ₃	H	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	H		Fp. = 130-131°C n _D ²⁰ = 1,5495
3.75	C ₆ H ₅	H	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	H		
3.76	C ₆ H ₅	H	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	CH ₂ -C ₆ H ₅	N-CH ₃	
3.77	C ₆ H ₅	H	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	Cl	
3.78	C ₆ H ₅	H	C ₄ H ₉	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	H	
3.79	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H		

Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
3.80	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇	
3.81	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇	H	H	
3.82	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	O-CH ₂ -CH ₂ -OH	
4.01	H	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	Cl	
4.02	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		CH ₃	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,64 (d), H ¹ ; 7,22 (s), H ⁴ ; 6,73 (d), H ²
4.03	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-CH ₃	Fp. = 193-194°C
4.04	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃		
4.05	C ₆ H ₅	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	
4.06	C ₆ H ₅	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	Cl	
4.07	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-CH ₂ - 	
4.08	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-CH ₂ -(3-CF ₃ -C ₆ H ₄)	
4.09	C ₆ H ₅	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	H	Fp. = 146-148°C
4.10	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-CH ₂ -C≡C	Fp. = 154-156°C
4.11	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-CH ₂ -(4-CF ₃ -C ₆ H ₄)	
4.12	CH ₃	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	OCH ₃		
4.13	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	NH-NH ₂	Fp. = 117-120°C
4.14	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-CH ₂ -(3-CF ₃ -C ₆ H ₄)	
4.15	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-(2-HOOC-C ₆ H ₄)	
4.16	CH ₃ -O-CH ₂	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	Cl	
4.17	CH ₃ -O-CH ₂	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	H	
4.18	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	N(C ₂ H ₅) ₂	Fp. = 148-149°C

Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
4.19	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	OCH ₃	
4.20	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	Cl	
4.21	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	H	
4.22	(-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -)		C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	CH ₂ -C ₆ H ₅	Fp. = 48-50°C
4.23	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-n-C ₄ H ₉	Fp. = 114-116°C
4.24	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -C ₆ H ₅	Fp. = 142-143°C
4.25	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	Cl	
4.26	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	
4.27	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -(4-F-C ₆ H ₄)	
4.28	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -(4-F-2-Cl-C ₆ H ₃)	
4.29	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -(3-F-C ₆ H ₄)	
4.30	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -CH=CH ₂	Fp. = 79-81°C
4.31	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	N(CH ₃)-C ₆ H ₅	Fp. = 88-89°C
4.32	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-C ₆ H ₅	Fp. = 188-189°C
4.33	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	Cl	Fp. = 93-95°C
4.34	CH ₃	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	OCH ₃	
4.35	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	OCH ₃	Fp. = 64-66°C
4.36	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H		Fp. = 119-121°C
4.37	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	Fp. = 156-158°C
4.38	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -CF ₃	
4.39	CH ₃	H	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ -C ₆ H ₅	
4.40	C ₆ H ₅	H	C ₂ H ₅	H	(CH ₂) ₅ - 	H	O-CH ₂ -CF ₃	
4.41	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -C≡CH	Fp. = 188-190°C

Beispiel Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	physikalische Eigenschaften
4.42	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	H	Fp. = 158–160°C
4.43	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	O-CH ₂ -C≡CH	Öl, ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,83 (d), H ² ; 6,78 (d), H ² ; 6,38 (s), H ³
4.44	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	N(C ₂ H ₅) ₂	Öl, ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,77 (d), H ² ; 6,74 (d), H ² ; 5,92 (s), H ³
4.45	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	NH-n-C ₄ H ₉	Öl, ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 7,78 (d), H ² ; 6,74 (d), H ² ; 5,94 (s), H ³
4.46	C ₆ H ₅	H	CH ₃	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	NH-n-C ₄ H ₉	Fp. = 121–123°C
4.47	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	SCH ₃	Fp. = 187–189°C
4.48	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	n-C ₄ H ₉	H	H	OCH ₃	SCH ₃	
4.49	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-NH ₂	
4.50	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇	H	H	OCH ₃	NH-CH ₂ -CH-CH ₂	Fp. = 108–110°C
4.51	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-CH ₂ -CH-CH ₂	Fp. = 84–85°C
4.52	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	N(CH ₂ -CH=CH ₂) ₂	Öl, ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 8,09 (s), H ² ; 7,79 (d), H ² ; 6,71 (d), H ²
4.53	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-n-C ₄ H ₉	Fp. = 138–139°C
4.54	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-CH ₂ -CH ₂ -OH	
4.55	CH ₃	H	CH ₃	H	H	OCH ₃	NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N 	Öl, ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]: 8,04 (s), H ² ; 7,79 (d), H ² ; 6,70 (d), H ²
4.56	CH ₃	H	CH ₃	H	H	Br	Cl	Fp. = 140–141°C

C. Biologische Beispiele

Beispiel 1

5 Etwa 5 Wochen alte Reispflanzen der Sorte "Ballilia" wurden mit den unten angegebenen Konzentrationen der erfindungsgemäßen Verbindungen behandelt. Nach Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Piricularia oryzae* gleichmäßig inokuliert und 48 h in eine dunkel gehaltene Klimakammer mit einer Temperatur von 25°C und 100% rel. Luftfeuchte gestellt. Danach wurden die Reispflanzen in einem Gewächshaus mit einer Temperatur von 25°C und 80% rel. Luftfeuchte weiterkultiviert. Nach 5 Tagen
 10 erfolgte die Befallsauswertung. Der Befallsgrad wurde in % befallener Blattfläche im Vergleich zu unbehandelten, infizierten Kontrollpflanzen ausgedrückt. Die Ergebnisse sind in Tabelle 2 zusammengestellt.

Tabelle 2

Verbindung gemäß Beispiel Nr.	mit <i>Piricularia oryzae</i> befallene Blattfläche in % bei mg Wirkstoff/Liter Spritzbrühe		
	500	250	125
1.02	0	0	0
3.16	0	0	0
3.01	0	0	0
1.04	0	0	0
1.03	0	0	—
2.20	0	0	0
3.45	0	0	0
2.24	0	0	0
3.02	0	0	0
3.32	0	0	—
1.10	0	0	0
3.61	0	0	0
3.50	0	0	0
unbehandelte, infizierte Pflanzen			100

Beispiel 2

Weizenpflanzen der Sorte "jubilar" wurden im 2-Blatt-Stadium mit wäßrigen Suspensionen der in Tabelle 3 angegebenen Präparate tropfnaß behandelt.

40 Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wäßrigen Pyknosporen-Suspension von *Leptosphaeria nodorum* inokuliert und mehrere Stunden bei 100% rel. Luftfeuchte in einer Klimakammer inkubiert. Bis zur Symptomausprägung wurden die Pflanzen im Gewächshaus bei ca. 90% Luftfeuchte weiterkultiviert.

Der Befallsgrad wurde in % befallener Blattfläche im Vergleich zu unbehandelten, infizierten Kontrollpflanzen ausgedrückt und ist in Tabelle 3 wiedergegeben.
 45

Tabelle 3

Verbindung gemäß Beispiel Nr.	mit <i>Leptosphaeria nodorum</i> befallene Blattfläche in % bei mg Wirkstoff/Liter Spritzbrühe		
	500	250	125
1.02	0	0	0
3.16	0	0	0
3.08	0	0	0
3.01	0	0	—
1.04	0	0	0
1.03	0	0	0
2.20	0	0	0
4.35	0	0	0
3.28	0	0	0
4.44	0	0	0
3.45	0	0	0
2.24	0	0	0
2.19	0	0	0
3.32	0	0	0
1.10	0	0	0
3.55	0	0	0
3.61	0	0	0
3.64	0	0	0
3.50	0	0	0
unbehandelte, infizierte Pflanzen			100

Beispiel 3

Gerstenpflanzen der Sorte "Igri" wurden im 2-Blatt-Stadium mit einer wäßrigen Suspension der beanspruchten Verbindungen tropfnaß behandelt.

Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Pyrenophora teres* inokuliert und für 16 h in einer Klimakammer bei 100% rel. Luftfeuchte inkubiert. Anschließend wurden die infizierten Pflanzen im Gewächshaus bei 25°C und 80% rel. Luftfeuchte weiterkultiviert.

Ca. 1 Woche nach Inkubation wurde der Befall ausgewertet. Der Befallsgrad wurde in % befallener Blattfläche im Vergleich zur unbehandelten, infizierten Kontrolle bonitiert. Die Ergebnisse sind in Tabelle 4 wiedergegeben.

Tabelle 4

Verbindung gemäß Beispiel Nr.	mit <i>Pyrenophora teres</i> befallene Blattfläche in % bei mg Wirkstoff/Liter Spritzbrühe		
	500	250	125
3.16	0	0	0
3.01	0	0	—
4.44	0	0	0
3.61	0	0	0
3.64	0	0	0
3.50	0	0	0
unbehandelte, infizierte Pflanzen			100

Beispiel 4

Ca. 14 Tage alte Ackerbohnen der Sorte "Herz Freya" oder "Frank's Ackerperle" wurden mit wäßrigen Suspensionen der beanspruchten Verbindungen tropfnaß behandelt.

Nach Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer Sporensuspension (1,5 Mio. Sporen/ml) von *Botrytis cinerea* inokuliert. Die Pflanzen wurden in einer Klimakammer bei 20–22°C und ca. 99% rel. Luftfeuchte weiterkultiviert. Die Infektion der Pflanzen äußert sich in der Bildung schwarzer Flecken auf Blättern und Stengeln. Die Auswertung der Versuche erfolgte ca. 1 Woche nach Inokulation.

Der Wirkungsgrad der Prüfsubstanzen wurde prozentual zur unbehandelten, infizierten Kontrolle bonitiert und ist in Tabelle 5 wiedergegeben.

Tabelle 5

Verbindung gemäß Beispiel Nr.	mit <i>Botrytis cinerea</i> befallene Blattfläche in % bei mg Wirkstoff/Liter Spritzbrühe 500
3.08	5
3.01	10
4.18	10
4.45	5
unbehandelte, infizierte Pflanzen	100

Beispiel 5

Gerstenpflanzen wurden im 2-Blatt-Stadium mit Konidien des Gerstenmehltaus (*Erysiphe graminis hordei*) stark inokuliert und in einem Gewächshaus bei 20°C und einer relativen Luftfeuchte von ca. 50% weiterkultiviert. 1 Tag nach Inokulation wurden die Pflanzen mit den in Tabelle 5 aufgeführten Verbindungen in den angegebenen Wirkstoffkonzentrationen gleichmäßig benetzt. Nach einer Inkubationszeit von 7–9 Tagen wurden die Pflanzen auf Befall mit Gerstenmehltau untersucht. Der Befallsgrad wird ausgedrückt in % befallener Blattfläche, bezogen auf unbehandelte, infizierte Kontrollpflanzen (= 100% Befall). Das Ergebnis ist in der Tabelle 6 zusammengefaßt.

Tabelle 6

Verbindung gemäß Beispiel Nr.	mit <i>Erysiphe graminis f. sp. hordei</i> befallene Blattfläche in % bei mg Wirkstoff/Liter Spritzbrühe 500 250	
1.04	0	5
2.20	0	5
3.45	0	0
2.24	0	5
3.55	0	5
unbehandelte, infizierte Pflanzen	100	

Beispiel 6

Tomatenpflanzen der Sorte "Rheinland Ruhm" wurden im 3–4 Blattstadium mit wäßrigen Suspensionen der beanspruchten Verbindungen gleichmäßig tropfnaß benetzt.

Nach dem Antrocknen wurden die Pflanzen mit einer Zoosporangien-Suspension von *Phytophthora infestans* inokuliert und für 2 Tage unter optimalen Infektionsbedingungen in einer Klimakammer gehalten. Danach wurden die Pflanzen bis zur Symptomausprägung im Gewächshaus weiterkultiviert.

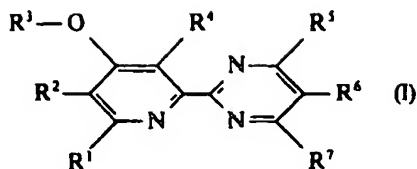
Die Befallsbonitur erfolgte ca. 1 Woche nach Inokulation. Der Befallsgrad der Pflanzen wurde in % befallener Blattfläche, bezogen auf unbehandelte, infizierte Pflanzen ausgedrückt und ist in Tabelle 7 wiedergegeben.

Tabelle 7

Verbindung gemäß Beispiel Nr.	mit <i>Phytophthora infestans</i> befallene Blattfläche in % bei mg Wirkstoff/Liter Spritzbrühe 500 250 125		
2.02	0	0	0
3.01	5	10	—
3.28	0	0	5
unbehandelte, infizierte Pflanzen	100		

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel I



worin

R^1 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkynyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu dreifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenylmercapto- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die vier letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein können, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^2, R^4 = unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, Phenyl wobei der Phenylrest bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein kann, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^1 und R^2 zusammen einen Teil eines maximal gesättigten 3- bis 8gliedrigen Ringes,

R^3 = (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein können, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^5 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_6) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkynyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu dreifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, (C_1-C_4) Haloalkyl, Halogen, Phenyl oder Phenyl- (C_1-C_4) alkyl wobei die zwei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein können, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^6 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Thioalkyl, (C_2-C_4) Alkenyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_2-C_4) Alkynyl- (C_1-C_4) alkoxy, Halogen, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, wobei die drei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein können, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^7 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkynyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu dreifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_6) Alkylthio, Halogen, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenylthio- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkoxy, Phenyl- (C_1-C_4) alkylthio, wobei die acht letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Carboxyl, Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro substituiert sein können, (C_2-C_4) Alkenyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_2-C_4) Alkynyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, Phenyl- (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_6) Hydroxyalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkylthio, Amine der Formel NR^8R^9 oder Hydrazine der Formel $NH-NR^8R^9$, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^8, R^9 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_6) Hydroxyalkyl, (C_3-C_7) Heterocyclyl- (C_1-C_6) alkyl, (C_2-C_4) Alkenyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_2-C_4) Alkynyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu zweifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, Formyl, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu zweifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, Carboxyl, (C_1-C_4) Alkoxy, Trifluormethyl oder Trichlormethyl substituiert sein können,

R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen unsubstituierten oder bis zu zweifach substituierten 5- bis 7gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 1 oder 2 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen substituiert bedeuten, sowie deren Säureadditionssalze.

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

R^1 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_2) alkyl, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_2) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die drei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert sein können,

R^2 = Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, Phenyl, das bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy substituiert sein kann,

R^1 und R^2 zusammen einen Teil eines maximal gesättigten 5- bis 7gliedrigen Ringes,

R^3 = (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_7) Cycloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_2) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, oder (C_1-C_4) Haloalkyl substituiert sein können, und Halo ein- oder mehrfach durch

Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^4 = Wasserstoff oder (C_1-C_4) Alkyl,

R^5 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl- (C_1-C_3) alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Halogen, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy oder (C_1-C_2) Haloalkyl substituiert sein können,

und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,
 R^6 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_2-C_4) Alkyl- (C_1-C_4) alkoxy, Halogen, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, wobei die drei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein können, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^7 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl- (C_1-C_3) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_2-C_6) Alkyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Hydroxyalkoxy, Phenyl- (C_1-C_2) alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkylthio, Halogen, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkoxy, Phenyl- (C_1-C_2) alkylthio, wobei die sechs letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Carboxyl, Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_2) Haloalkyl oder (C_1-C_3) Haloalkoxy substituiert sein können, Amine der Formel NR^8R^9 oder Hydrazine der Formel $NH-NR^8N^9$, und Halo ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R^8, R^9 = unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Hydroxyalkyl, (C_3-C_6) Heterocycl- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_3) Alkenyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_2-C_3) Alkyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl- (C_1-C_2) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu zweifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, Formyl, Phenyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu zweifach durch Halogen, (C_1-C_3) Alkyl, Carboxyl, (C_1-C_3) Alkoxy, Trifluormethyl oder Trichlormethyl substituiert sein können,

R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen unsubstituierten oder bis zu zweifach substituierten 5- bis 7gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocycl mit 1 oder 2 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen bedeuten, sowie deren Säureadditionssalze.

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß

R^1 = Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-methyl, Phenyl, Phenoxy-methyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, wobei die drei letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy substituiert sein können,

R^2 = Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, Phenyl, wobei Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert sein kann,

R^1 und R^2 zusammen einen Teil eines maximal ungesättigten 5- bis 7gliedrigen Ringes,

R^3 = (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, Phenoxy- (C_1-C_2) alkyl, wobei der Phenylrest der beiden letzten Beispiele bis zu dreifach mit Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, oder (C_1-C_4) Haloalkyl substituiert sein kann,

R^4 = Wasserstoff oder (C_1-C_2) Alkyl,

R^5 = Wasserstoff, (C_1-C_6) Alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl- (C_1-C_3) alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, Halogen, Phenyl, Phenyl-methyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil unsubstituiert oder bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy oder (C_1-C_2) Haloalkyl substituiert sein können,

R^6 = Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, Halogen, Phenyl, Phenyl-methyl, wobei der Phenylrest der beiden letzten Beispiele bis zu dreifach mit Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy oder (C_1-C_4) Haloalkyl substituiert sein kann,

R^7 = Wasserstoff, (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl-methyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkyl- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl- (C_1-C_2) alkoxy, (C_2-C_6) Alkyl- (C_1-C_3) alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_2) alkoxy, (C_1-C_4) Hydroxyalkoxy, Halogen, Phenyl-methoxy- (C_1-C_4) alkoxy, Phenyl, Phenoxy, Phenylmercapto, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkoxy, Phenyl-methylthio, wobei die sieben letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Carboxyl, Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_2) Haloalkyl oder (C_1-C_3) Haloalkoxy substituiert sein können, Amine der Form NR^8R^9 oder Hydrazine der Form $NH-NR^8N^9$,

R^8, R^9 jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_2) Hydroxyalkyl, (C_3-C_6) Heterocycl- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_3) Alkenyl-methyl, (C_2-C_3) Alkyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl-methyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Cycloalkylteil bis zu zweifach durch (C_1-C_4) Alkyl substituiert sein können, Formyl, Phenyl, Phenyl-methyl, wobei die beiden letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu zweifach durch Halogen, (C_1-C_3) Alkyl, (C_1-C_3) Alkoxy, Carboxyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl substituiert sein können, und

R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen unsubstituierten oder bis zu zweifach substituierten 5- bis 6gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocycl mit 1 oder 2 gleichen oder verschiedenen Heteroatomen bedeuten, sowie deren Säureadditionssalze.

4. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß man

a) für Verbindungen mit R^7 = Wasserstoff ein entsprechendes Halopyrimidin der Formel I mit R^7 = Halogen und allen übrigen Substituenten in den genannten Bedeutungen reaktiv dehalogeniert oder

b) für Verbindungen der Formel I, worin R^7 für (C_1-C_{18}) Alkoxy, (C_1-C_3) Alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl-
 (C_1-C_4) alkoxy, (C_2-C_6) Alkylthio- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, Phenyl- (C_1-C_2) alkoxy- (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio- (C_1-C_4) alkylthio, Phenoxy, Phenyl-
 mercapto, Phenyl- (C_1-C_2) alkoxy, Phenyl- (C_1-C_2) alkylthio, wobei die vier letztgenannten Reste im Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_2) Haloalkyl oder (C_1-C_3) Haloalkoxy substituiert sein können, steht, ein entsprechendes Halopyrimidin der Formel I mit R^7 = Halogen mit einer Alkalimetallverbindung der Formel II

R^7-Y (II),

worin R^7 die obengenannte Bedeutung besitzt und Y für ein Alkalimetall steht, umsetzt, oder

c) für Verbindungen der Formel I, worin R^7 für (C_1-C_6) Alkyl, Phenyl- (C_1-C_2) alkyl, (C_3-C_6) Cycloalkyl, (C_5-C_6) Cycloalkyl- (C_1-C_3) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkylthio oder Phenyl steht, wobei der letztgenannte Rest bis zu dreifach durch (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy substituiert sein kann, ein entsprechendes Halopyrimidin der Formel I mit R^7 = Halogen mit einer Grignardverbindung der Formel III,

R^7-MgX (III),

worin R^7 die obengenannte Bedeutung besitzt und X = Halogen bedeutet, in Gegenwart von Nickel-Phosphin-Komplexen umsetzt oder

d) für Verbindungen der Formel I, worin R^7 für NR^8R^9 steht, und R^8 , R^9 die unter Formel I genannte Bedeutung haben, ein entsprechendes Halopyrimidin der Formel I mit R^7 = Halogen mit einem primären oder sekundären Amin der Formel IV

HNR^8R^9 (IV)

umsetzt.

5. Fungizide Mittel, dadurch gekennzeichnet, daß sie eine wirksame Menge einer Verbindung der Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 3 enthalten.

6. Verwendung von Verbindungen der Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 3 zur Bekämpfung von Schadpilzen.

7. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die von ihnen befallenen Pflanzen, Flächen oder Substrate eine wirksame Menge einer Verbindung der Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 3 appliziert.

— Leerseite —

THIS PAGE BLANK (USPTO)